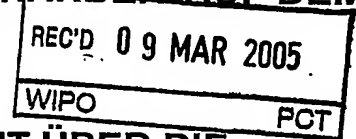



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT

(Kapitel II des Vertrags über die internationale Zusammenarbeit auf dem Gebiet



Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts P1162PCT	WEITERES VORGEHEN siehe Formblatt PCT/PEA/416	
Internationales Aktenzeichen PCT/CH2004/000175	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 22.03.2004	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 20.03.2003
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D513/04, C07D277/B2, C07D277/60, C07D417/04, A61K31/428, A61K31/429, A61K31/437		
Anmelder ACTELION PHARMACEUTICALS LTD et al		
<p>1. Bei diesem Bericht handelt es sich um den internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, der von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde nach Artikel 35 erstellt wurde und dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt wird.</p> <p>2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.</p> <p>3. Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; diese umfassen</p> <p>a. <input type="checkbox"/> (an den Anmelder und das Internationale Büro gesandt) insgesamt Blätter; dabei handelt es sich um</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter mit der Beschreibung, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit Berichtigungen, denen die Behörde zugestimmt hat (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsvorschriften).</p> <p><input type="checkbox"/> Blätter, die frühere Blätter ersetzen, die aber aus den in Feld Nr. 1, Punkt 4 und im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde eine Änderung enthalten, die über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgeht.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (nur an das Internationale Büro gesandt) insgesamt (bitte Art und Anzahl der/des elektronischen Datenträger(s) angeben), der/die ein Sequenzprotokoll und/oder die dazugehörigen Tabellen enthält/enthalten, nur in computerlesbarer Form, wie im Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll angegeben (siehe Abschnitt 802 der Verwaltungsvorschriften).</p>		
<p>4. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. I Grundlage des Bescheids</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. II Priorität</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. IV Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VI Bestimmte angeführte Unterlagen</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VII Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung</p> <p><input type="checkbox"/> Feld Nr. VIII Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung</p>		
Datum der Einreichung des Antrags 16.09.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 09.03.2005	
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Allard, M Tel. +31 70 340-2002	



Feld Nr. I Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Sprache** beruht der Bericht auf der internationalen Anmeldung in der Sprache, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.
- ☐ Der Bericht beruht auf einer Übersetzung aus der Originalsprache in die folgende Sprache, bei der es sich um die Sprache der Übersetzung handelt, die für folgenden Zweck eingereicht worden ist:
- ☐ internationale Recherche (nach Regeln 12.3 und 23.1 b))
 - ☐ Veröffentlichung der internationalen Anmeldung (nach Regel 12.4)
 - ☐ internationale vorläufige Prüfung (nach Regeln 55.2 und/oder 55.3)
2. Hinsichtlich der **Bestandteile*** der internationalen Anmeldung beruht der Bericht auf *(Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt)*:

Beschreibung, Seiten

1-92 In der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-21 In der ursprünglich eingereichten Fassung

☐ einem Sequenzprotokoll und/oder etwaigen dazugehörigen Tabellen - siehe Zusatzfeld betreffend das Sequenzprotokoll

3. ☐ Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):
4. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der diesem Bericht beigelegten und nachstehend aufgelisteten Änderungen erstellt worden, da diese aus den im Zusatzfeld angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).
- ☐ Beschreibung: Seite
 - ☐ Ansprüche: Nr.
 - ☐ Zeichnungen: Blatt/Abb.
 - ☐ Sequenzprotokoll (*genaue Angaben*):
 - ☐ etwaige zum Sequenzprotokoll gehörende Tabellen (*genaue Angaben*):

* Wenn Punkt 4 zutrifft, können einige oder alle dieser Blätter mit der Bemerkung "ersetzt" versehen werden.

Feld Nr. III Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit

1. Folgende Teile der Anmeldung wurden nicht daraufhin geprüft, ob die beanspruchte Erfindung als neu, auf erfinderischer Tätigkeit beruhend (nicht offensichtlich) und gewerblich anwendbar anzusehen ist:

- ☐ die gesamte internationale Anmeldung,
☒ Ansprüche Nr. 1-7,19,20 (alle teilweise und nur hinsichtlich gewerblicher Anwendbarkeit)

Begründung:

- ☒ Die gesamte internationale Anmeldung, bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. 1-7,19,20 (alle teilweise und nur hinsichtlich gewerblicher Anwendbarkeit) beziehen sich auf den nachstehenden Gegenstand, für den keine internationale vorläufige Prüfung durchgeführt werden braucht (*genaue Angaben*):

siehe Beiblatt

- ☐ Die Beschreibung, die Ansprüche oder die Zeichnungen (*machen Sie bitte nachstehend genaue Angaben*) oder die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unklar, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte (*genaue Angaben*):
- ☐ Die Ansprüche bzw. die obengenannten Ansprüche Nr. sind so unzureichend durch die Beschreibung gestützt, daß kein sinnvolles Gutachten erstellt werden konnte.
- ☐ Für die obengenannten Ansprüche Nr. wurde kein internationaler Recherchenbericht erstellt.
- ☐ Das Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzprotokoll entspricht nicht dem in Anhang C zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen Standard, weil
- | | |
|--------------------------|---|
| die schriftliche Form | <input type="checkbox"/> nicht eingereicht wurde. |
| | <input type="checkbox"/> nicht dem Standard entspricht. |
| die computerlesbare Form | <input type="checkbox"/> nicht eingereicht wurde. |
| | <input type="checkbox"/> nicht dem Standard entspricht. |
- ☐ Die Tabellen zum Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenzprotokoll, sofern sie nur in computerlesbarer Form vorliegen, entsprechen nicht den in Anhang C-bis zu den Verwaltungsvorschriften vorgeschriebenen technischen Anforderungen.
- ☐ siehe Beiblatt für weitere Angaben.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER BERICHT
ÜBER DIE PATENTIERBARKEIT**

Internationales Aktenzeichen
PCT/CH2004/000175

Feld Nr. V Begründete Feststellung nach Artikel 35 (2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|--------------------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 5,12-15,17-20 |
| | Nein: Ansprüche 1-4,6-11,16,21 |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 5,12-15,17-20 |
| | Nein: Ansprüche 1-4,6-11,16,21 |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 8-18,21 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen (Regel 70.7):

siehe Beiblatt

Es wird auf die folgenden Dokumente verwiesen:

- D1: GB-A-1 140 387 (DR. KARL THOMAE G.M.B.H.) 15. Januar 1969 (1969-01-15)
D2: MARINKO P ET AL: "A convenient synthesis of 4-aminomethyl-4,5,6,7-tetrahydro-1,3-benzothiazole arginine side-chain mimetics" TETRAHEDRON LETTERS, Bd. 42, Nr. 50, 10. Dezember 2001 (2001-12-10), Seiten 8911-8913, XP004322573
D3: WO 02/24192 A (INSTITUT NATIONAL DE LA SANTE ET DE LA RECHERCHE MEDICALE ET AL) 28. März 2002 (2002-03-28)

Zu Punkt III

Keine Erstellung eines Gutachtens über gewerbliche Anwendbarkeit

Die Ansprüche 1-7, 19 und 20 beziehen sich teilweise auf einen Gegenstand, der nach Auffassung dieser Behörde unter die Regel 67.1 (iv) PCT fällt. Daher wird über die gewerbliche Anwendbarkeit des Gegenstands dieser Ansprüche kein Gutachten erstellt (Artikel 34(4) a) (i) PCT).

Zu Punkt V

Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Neuheit (Artikel 33(2) PCT)

D1 offenbart analgetische Thiazolopyridine, siehe Ansprüche 1 und 50. Zumindest die Verbindung aus Beispiel 58 von D1 steht dem Gegenstand der Ansprüche 1-4, 6 und 7 der vorliegenden Anmeldung neuheitsschädlich gegenüber.

Weiterhin ist der Gegenstand der Ansprüche 8-11, 16 und 21 nicht neu im Hinblick auf die Lehre von D2, siehe Seite 8912, Verbindung 6b.

Der Gegenstand der Ansprüche 5, 12-15 und 17-20 wird nicht im verfügbaren Stand der Technik beschrieben und ist somit neu.

Erfinderische Tätigkeit (Artikel 33(3) PCT)

Für den Gegenstand der Ansprüche 1-4, 6-11, 16 und 21, welcher nicht neu ist, besteht keine Basis zur Anerkennung einer erfinderischen Tätigkeit.

Für den neuen Gegenstand der Ansprüche 1-4, 6-11, 16 und 21, weiterhin für den Gegenstand der Ansprüche 5, 12-15 und 17-20, kann eine erfinderische Tätigkeit anerkannt werden: im Hinblick auf die in dem nächstliegenden Stand der Technik D3 beschriebenen Verbindungen löst dieser Gegenstand die Aufgabe der Bereitstellung von weiteren Neuropeptid FF Rezeptor-Antagonisten in einer für den Fachmann nicht naheliegenden Weise.

Gewerbliche Anwendbarkeit (Artikel 33(4) PCT)

Die Verbindungen und das Verfahren der Ansprüche 8-18 und 21 können in der pharmazeutischen Industrie angewendet werden.

Zu Punkt VIII

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Die in Anspruch 1 benutzte Formulierung "zur Herstellung entsprechender Arzneimittel", implizit also zur Herstellung von Arzneimitteln mit Neuropeptid FF Rezeptor-antagonistischer Wirkung, ist nicht klar im Hinblick auf den genauen Umfang dieses Anspruchs, da der Fachmann nicht ohne Weiteres in der Lage ist festzustellen, welche Krankheit präzise gemeint ist.